

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
24. Juli 2003 (24.07.2003)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 03/059335 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: A61K 31/10,
31/4465, 31/4409, 31/496, 31/40, 31/5375, A61P 25/28,
C07C 317/22, C07D 295/20, 213/74, 241/08, 211/46,
211/22, 493/10, 211/52

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP03/00052

(22) Internationales Anmeldedatum:
7. Januar 2003 (07.01.2003)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
102 01 392.6 16. Januar 2002 (16.01.2002) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme
von US): BAYER AKTIENGESELLSCHAFT (DE/DE);
51368 Leverkusen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): HENDRIX, Martin
[DE/DE]; Im Geroden 5, 51519 Odenthal (DE). BAU-
MANN, Karlheinz [DE/DE]; Urbachstr. 52, 45239 Essen
(DE). GROSSER, Rolf [DE/DE]; Gellertstr. 9, 51373
Leverkusen (DE). KÖNIG, Gerhard [DE/DE]; Tannen-
str. 8, 40476 Düsseldorf (DE). DÜSTERHUS, Vera
[DE/DE]; Damaschkestr. 13, 51469 Bergisch Gladbach
(DE). KRÜGER, Joachim [DE/DE]; Golzheimer Platz 4,
40474 Düsseldorf (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER AKTIENGE-
SELLSCHAFT; 51368 Leverkusen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT,
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR,
CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE,

GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR,
KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK,
MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU,
SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA,
UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SI, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),
eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,
TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE,
DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL,
PT, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI,
CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Erklärung gemäß Regel 4.17:

— hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu
beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii) für die
folgenden Bestimmungsstaaten AE, AG, AL, AM, AT, AU,
AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU,
CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH,
GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC,
LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX,
MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK,
SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VC, VN, YU, ZA,
ZM, ZW, ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD,
SI, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY,
KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE,
BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU,
IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF,
BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN,
TD, TG)

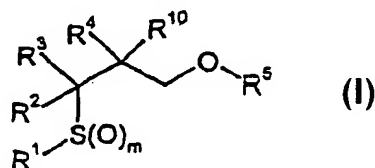
Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen
Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on
Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe
der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: PHENYL SULFOXIDES AND PHENYL SULFONES

(54) Bezeichnung: PHENYL SULFOXIDE UND -SULFONE



(57) Abstract: The invention relates to the phenyl sulfoxides and phenyl
sulfones of formula (I) and to methods for producing the same as well as to
their use in the production of drugs for the treatment and/or prophylaxis of
diseases, especially Alzheimer's disease. The inventive compounds inhibit γ
secretase.

(57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft Phenylsulfoxide und -sul-
fone der Formel (I) und Verfahren zu ihrer Herstellung sowie ihre Verwen-
dung zur Herstellung von Arzneimitteln zur Behandlung und/oder Propy-
laxe von Krankheiten, insbesondere der Alzheimerschen Krankheit. Die er-
findungsgemäßen Verbindungen inhibieren γ -Sekretase. (Formel I).

WO 03/059335 A1